

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年7月14日 (14.07.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/063743 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 417/04,  
417/14, 491/113, 487/04, 498/04, 513/04, A61K 31/427,  
31/4439, 31/444, 31/454, 31/4725, 31/496, 31/497,  
31/501, 31/506, 31/541, 31/551, 31/553, 31/695, 31/438,  
31/4985, 31/5383, 31/542, A61P 3/10, 9/10, 25/00, 25/14,  
25/16, 25/20, 25/22, 25/24, 25/28, 25/30

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/019778

(22) 国際出願日: 2004年12月24日 (24.12.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

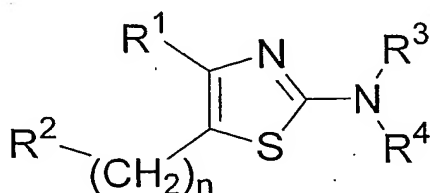
(30) 優先権データ:  
特願 2003-432777  
2003年12月26日 (26.12.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 協和醸酵  
工業株式会社 (KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.)  
[JP/JP]; 〒1008185 東京都千代田区大手町一丁目6番  
1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中島 高雄 (NAKA-  
JIMA, Takao). 菅原 正森 (SUGAWARA, Masamori).  
内田 真一 (UCHIDA, Shin-ichi). 大野 哲司 (OHNO,Tetsuji). 野本 裕二 (NOMOTO, Yuji). 上坂 範明 (UE-  
SAKA, Noriaki). 中里 宜資 (NAKASATO, Yoshisuke).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護  
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,  
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,  
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,  
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:  
— 国際調査報告書2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: THIAZOLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: チアゾール誘導体



(1)

(57) Abstract: An adenosine A<sub>2A</sub> receptor  
antagonist which contains as an active  
ingredient either a thiazole derivative  
represented by the following general formula  
(I): (I) (wherein n is an integer of 0 to 3;  
R<sup>1</sup> represents (un)substituted cycloalkyl,  
(un)substituted aryl, (un)substituted alicyclic  
heterocyclic group, or (un)substituted  
aromatic heterocyclic group; R<sup>2</sup> representshalogeno, (un)substituted lower alkyl, (un)substituted aryl, (un)substituted alicyclic heterocyclic group, (un)substituted aromatic  
heterocyclic group, -COR<sup>8</sup>, etc.; and R<sup>3</sup> and R<sup>4</sup> are the same or different and each represents hydrogen, (un)substituted lower alkyl,  
(un)substituted aralkyl, -COR<sup>12</sup>, etc.) or a pharmacologically acceptable salt of the derivative.

[続葉有]

BEST AVAILABLE COPY

WO 2005/063743 A1